

[Generate Collection](#)

L3: Entry 19 of 24

File: DWPI

Jan 19, 2004

DERWENT-ACC-NO: 1995-228598

DERWENT-WEEK: 200410

COPYRIGHT 2004 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: 5-Alpha-reductase inhibitors used as lotions to promote hair growth - contain plant extracts of *Smilax zeylanica*, *phyllanthus nuriri*, *Woodfordia fruticosa*, *Lagerstroemia speciosa* and/or *Cymbopogon nardus*.

PATENT-ASSIGNEE: MIKIMOTO SEIYAKU KK (MIKIN), NANBA T (NANBI)

PRIORITY-DATA: 1993JP-0288451 (November 17, 1993)

[Search Selected](#) [Search ALL](#) [Clear](#)

PATENT-FAMILY:

PUB-NO	PUB-DATE	LANGUAGE	PAGES	MAIN-IPC
<input type="checkbox"/> JP 3487619 B2	January 19, 2004		005	A61K007/06
<input type="checkbox"/> JP 07138135 A	May 30, 1995		005	A61K007/06

APPLICATION-DATA:

PUB-NO	APPL-DATE	APPL-NO	DESCRIPTOR
JP 3487619B2	November 17, 1993	1993JP-0288451	
JP 3487619B2		JP 7138135	Previous Publ.
JP 07138135A	November 17, 1993	1993JP-0288451	

INT-CL (IPC): A61 K 7/00; A61 K 7/06; A61 K 35/78

ABSTRACTED-PUB-NO: JP 07138135A

BASIC-ABSTRACT:

5-alpha-reductase inhibitors contg one or more plant extracts of *Smilax zeylanica*, *phyllanthus nuriri*, *Woodfordia fruticosa*, *Lagerstroemia speciosa*, or *Cymbopogon nardus*, are new.

The plant is extracted in organic solvent such as ethanol, or methanol.

USE - 5 alpha reductase inhibitors are used as hair-growing agents such as hair lotion.

In an example, dried root of *Smilax zeylanica* (10g) was extracted in 50% ethanol (300 ml) for 5 days, and freeze-dried to give the *Smilax* extract. The extract (0.5 wt%), olive oil (0.5%), polyoxyethylene sorbitan monostearate (2.0%), polyoxyethylene hardened castor oil (2.0%, ethanol (30.0%), 1.0% sodium hyaluronate-contg aq soln (5.0%) and refined water (60.0%) were formed into a hair lotion.

ABSTRACTED-PUB-NO: JP 07138135A

EQUIVALENT-ABSTRACTS:

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0

DERWENT-CLASS: B04 D21

CPI-CODES: B04-A10; B14-D05D; B14-R02; D08-B03;

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平7-138135

(43)公開日 平成7年(1995)5月30日

(51)Int.Cl.⁸

識別記号 庁内整理番号

F I

技術表示箇所

A 61 K 7/06

7/00

K

35/78

ADA W 8217-4C

AED

審査請求 未請求 請求項の数1 O.L (全 5 頁)

(21)出願番号

特願平5-288451

(22)出願日

平成5年(1993)11月17日

(71)出願人 000166959

御木本製薬株式会社

三重県伊勢市黒瀬町1425番地

(71)出願人 591168323

難波 恒雄

富山県富山市五福末広町2556-4 1-

104

(72)発明者 難波 恒雄

富山県富山市五福末広町2556-4 1-

104

(74)代理人 弁理士 藤本 博光 (外2名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 5 α -レダクターゼ阻害剤

(57)【要約】

【構成】 スミラックス ゼイラニカ、フィランサス
ヌリリ、ウッドフォルディア フルーティコサ、オオバ
ナサルスペリ、コウスイガヤよりなる群より選んだ少な
くとも1種の植物体の溶媒抽出物を含むる α -レダクタ
ーゼ阻害剤。

【効果】 本発明に使用した植物体の溶媒抽出物は α
-レダクターゼの活性を著しく阻害するので、これを配
合した育毛料は顕著な効果を示す。

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】スミラックス ゼイラニカ、フィランサス ヌリリ、ウッドフォルディア フルーティコサ、オオバナサルスベリ、コウスイガヤよりなる群より選んだ少なくとも1種の溶媒抽出物を含む 5α -レダクターゼ阻害剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、育毛上障害となる 5α -レダクターゼの活性を阻害して、育毛に有効な 5α -レダクターゼ阻害剤に関する。

【0002】

【従来の技術】スミラックス ゼイラニカ (*Smilax zeylanica*) はユリ科シオデ属の植物で、インドやスリランカの1500m以上の高地によく見られる。その根はリュウマチ、赤痢、貧血、性病等に用いられる。

【0003】フィランサス ヌリリ (*phyllanthus nuri* ri) はトウダイグサ科の植物で、熱帯地方に広く分布し、スリランカでは荒れ地や耕地に雑草として分布する。

【0004】ウッドフォルディア フルーティコサ (*Woodfordia fruticosa*) はミソハギ科の植物でインド、スリランカの低山地の日当りのよい場所に分布している。花は赤痺、葉は蛇に咬まれたときの薬として利用される。

【0005】オオバナサルスベリ (*Lagerstroemia speciosa*) は、ミソハギ科、サルスベリ属の植物で、インドに生える半落葉高木である。インドでは根は熱、下痢に、樹皮、葉は下剤として用いられる。

【0006】コウスイガヤ (*Cymbopogon nardus*) は単子葉植物綱、イネ目、イネ科、オガルカヤ属の植物で、蚊の防虫剤、香料、石鹼の原料とされ、南アフリカでは駆虫剤、風邪の治療薬、解熱剤に使われている。

【0007】 5α -レダクターゼは、育毛を妨げる還元剤として作用する酵素として知られている。従って、この 5α -レダクターゼの活性を阻害することは育毛に有効に作用するものである。

【0008】一方、化粧料の原料として使用でき 5α -レダクターゼ阻害作用のある物質としては種々の物質が知られているが、合成品は、長期間人間の肌に適応した場合の安全性の保証がなく、使用が制限されつつある。一方、天然物では 5α -レダクターゼ阻害作用が弱いものが多い。しかし人の肌に対する安全性の面から天然物で、多年、人が食したりして、安全性の面で保証されており、しかも 5α -レダクターゼ阻害作用が強いものが要求されていた。

【0009】

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、皮膚に適用して安全であると共に、 5α -レダクターゼ阻害作用が大きい 5α -レダクターゼ阻害剤を提供すること

2

である。

【0010】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、前記の課題を解決するため、すでに年にわたって食用に供され、人体に対する安全性が確認されている植物をスクリーニングして調べ、 5α -レダクターゼ阻害剤として利用価値のあるものを検討した。その結果、前記の植物体の溶媒抽出物が、 5α -レダクターゼ阻害剤として、或いは医薬部外品として非常に有効であることを見い出し本発明を完成した。

【0011】すなわち本発明はスミラックス ゼイラニカ、フィランサス ヌリリ、ウッドフォルディア フルーティコサ、オオバナサルスベリ、コウスイガヤよりなる群より選んだ少なくとも1種の溶媒抽出物を含む 5α -レダクターゼ阻害剤である。

【0012】これら植物体の利用方法としては、水或いは親水性有機溶媒例えは、エタノール、メタノール、アセトン等で抽出する。しかしながら人の皮膚に適用する 5α -レダクターゼ阻害剤原料の抽出であるから、水或いはエタノール或いはこれの混合溶媒での抽出が好ましいのは当然である。

【0013】また、場合によっては、グリセリン、1,3ブチレングリコール、プロピレングリコール等の多価アルコール又は多価アルコールと水の混液も抽出に利用できる。またさらに凍結乾燥して粉体として利用することも利用方法によっては有効である。

【0014】この物質を他の化粧品原料例えはスクワラン、ホホバ油等の液状油、ミツロウ、セチルアルコール等の固体油、各種の活性剤、グリセリン、1,3ブチレングリコール等の保湿剤や各種薬剤等を添加してさまざまな剤形の 5α -レダクターゼ阻害剤を調製することができる。例えローション、クリーム、乳液、パック等で目的に応じて利用形態を考えればよい。

【0015】

【実施例】以下に本発明で使用する植物体の実際の利用方法である抽出物の製造例、実施例を記載するが、本発明はこれらの製造例、実施例によって何等限定されるものではない。

【0016】(製造例1)スミラックス ゼイラニカの根茎(乾燥品)10gに50%エタノール300mlを加えて、時々攪拌しつつ5日間放置した。これを沪過後、エバボレートして、凍結乾燥した。

【0017】(製造例2)スミラックス ゼイラニカの根茎(乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。

【0018】(製造例3)フィランサス ヌリリの全草(乾燥品)を10gにエタノール300mlを加えて時々攪拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0019】(製造例4)フィランサス ヌリリの全草

50

(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0020】(製造例5) フィランサス ヌリリの全草(乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。

【0021】(製造例6) ウッドフォルディア フルティコサの花及び葉(乾燥品)を10gにエタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0022】(製造例7) ウッドフォルディア フルティコサの花及び葉(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後、エバボレートして、凍結乾燥した。

【0023】(製造例8) ウッドフォルディア フルティコサの花及び葉(乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。

【0024】(製造例9) オオバナサルスベリの葉(乾燥品)を10gにエタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0025】(製造例10) オオバナサルスベリの葉(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバ*

(実施例1) ローションの調製

	(重量%)
オリーブ油	0.5
製造例1の抽出物	0.5
ポリオキシエチレン(20E.O.)ソルビタンモノステアレート	2.0
ポリオキシエチレン(60E.O.)硬化ヒマシ油	2.0
エタノール	30.0
1.0%ヒアルロン酸ナトリウム水溶液	5.0
精製水	60.0

【0033】(実施例2) 実施例2は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例2の抽出物に変え作成したローション。

【0034】(実施例3) 実施例3は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例3の抽出物に変え作成したローション。

【0035】(実施例4) 実施例4は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例4の抽出物に変え作成したローション。

【0036】(実施例5) 実施例5は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例5の抽出物に変え作成したローション。

【0037】(実施例6) 実施例6は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例6の抽出物に変え作成したローション。

【0038】(実施例7) 実施例7は、実施例1の製造

* ポレートし凍結乾燥した。

【0026】(製造例11) オオバナサルスベリの葉(乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。

【0027】(製造例12) コウスイガヤの根茎(乾燥品)を10gにエタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0028】(製造例13) コウスイガヤの根茎(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0029】(製造例14) コウスイガヤの根茎(乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後、沪過後凍結乾燥した。

【0030】(比較製造例1) カシュー(何首鳥)の塊根(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0031】(比較製造例2) セージの種子(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加えて時々搅拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレートし凍結乾燥した。

【0032】

※例1の抽出物を製造例7の抽出物に変え作成したローション。

【0039】(実施例8) 実施例8は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例8の抽出物に変え作成したローション。

【0040】(実施例9) 実施例9は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例9の抽出物に変え作成したローション。

【0041】(実施例10) 実施例10は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例10の抽出物に変え作成したローション。

【0042】(実施例11) 実施例11は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例11の抽出物に変え作成したローション。

【0043】(実施例12) 実施例12は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例12の抽出物に変え作成した

ローション。

【0044】(実施例13) 実施例13は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例13の抽出物に変え作成したローション。

【0045】(実施例14) 実施例14は、実施例1の製造例1の抽出物を製造例14の抽出物に変え作成したローション。

【0046】(5 α -レダクターゼ阻害試験)

(試験方法) 製造例及び比較例の1%液を0.5mL、0.18%テストステロン、プロピレンギコール溶液 10を0.5mL、0.1% β -ニコチンアミドアデニジヌクレオチドリン酸(NADPH)、トリス-HC1緩衝液(50mM, pH7.2)を5.0mL、5 α -レダクターゼ酵素液としてオリエンタル酵母工業株式会社製 S-9を1.0mL、これらをよく混合し、37°Cで30min恒温水槽に放置する。

【0047】次にエキストレート20カラム(メルク社製)に入れ、10min放置した後、ジクロロメタン40~50mLで分取する。エバポレート後、エタノール5mLに溶解しガスクロマトグラフィー分析で分析した。

GC条件は

カラム: CBP1-W12-100(メチルシリコーン系)

カラム温度: 235°C恒温

検出器: 水素炎検出器(FID); 280°C, インジエクション; 280°C

その結果を表1に示す。

【0048】

【表1】

検体名	阻害率
製造例1	27.1%
製造例2	23.6%
製造例3	35.0%
製造例4	40.7%
製造例5	42.1%
製造例6	78.9%
製造例7	44.0%
製造例8	55.0%
製造例9	27.6%
製造例10	65.1%
製造例11	53.7%
製造例12	47.0%
製造例13	21.3%
製造例14	54.5%
比較製造例1	3.8%
比較製造例2	15.3%

【0049】(使用テスト) 男性で、頭髪が薄くなりつある人に各実施例のローションを6ヶ月間毎日使用してもらった。各実施例毎に5人をパネルとして依頼した。その評価基準を有効と判定した人、やや有効と判定した人、効果なしと判定した人に分けて、その人数を表2に示す。

【0050】

【表2】

7

8

	有効	やや有効	効果なし
実施例1	2	1	2
実施例2	2	2	1
実施例3	3	1	1
実施例4	3	0	2
実施例5	3	1	1
実施例6	4	1	0
実施例7	3	1	1
実施例8	4	0	1
実施例9	2	2	1
実施例10	4	1	0
実施例11	3	2	0
実施例12	3	1	1
実施例13	1	4	0
実施例14	2	3	0

【0051】

【発明の効果】本発明の植物体の溶媒抽出物は、 5α -レダクターゼ阻害試験で明らかのように、 5α -レダク*

* ターゼの活性を顕著に抑制するので、これを配合したローションを頭皮に適用すると、優れた育毛効果が得られる。

フロントページの続き

(72)発明者 服部 征雄

富山県富山市五福末広町2556-4 2-
203

(72)発明者 下村 健次

三重県伊勢市船江3-16-32

(72)発明者 山辺 幸久

三重県伊勢市河崎1-8-21

(72)発明者 飯田 浩一

三重県伊勢市黒瀬町56-1